

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
14. März 2002 (14.03.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 02/19973 A2

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61K 7/00, 7/48

(DE). LINDEMANN, Wiebke [DE/DE]; Lappen-  
bergsallee 4b, 20257 Hamburg (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/09306

(74) Gemeinsamer Vertreter: BEIERSDORF AG; Unnastr.  
48, 20245 Hamburg (DE).

(22) Internationales Anmeldedatum:  
11. August 2001 (11.08.2001)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): BR, CN, IN, JP, KE,  
MX, US, ZA.

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): europäisches Patent (AT,  
BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC,  
NL, PT, SE, TR).

(30) Angaben zur Priorität:  
100 44 313.3 7. September 2000 (07.09.2000) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): BEIERSDORF AG [DE/DE]; Unnastr. 48, 20245  
Hamburg (DE).

Veröffentlicht:  
— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu  
veröffentlichen nach Erhalt des Berichts

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): RIEDEL, Heidi  
[DE/DE]; Lokstedter Steindamm 24, 22529 Hamburg

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen  
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on  
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe  
der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: LOW-LIPID COSMETIC AND DERMATOLOGICAL PREPARATIONS IN THE FORM OF O/W EMULSIONS CON-  
TAINING FATTY ACIDS

(54) Bezeichnung: LIPIDARME KOSMETISCHE UND DERMATOLOGISCHE ZUBEREITUNGEN IN FORM VON  
O/W-EMULSIONEN MIT EINEM GEHALT AN FETTSÄUREN

(57) Abstract: The invention relates to cosmetic or dermatological preparations in the form of an O/W emulsion containing in relation to the overall weight of the preparations, (I) 1-5 wt. % of one or several neutralized or partially neutralized C<sub>14</sub>-C<sub>32</sub> fatty acids, (II) whereby sodium hydroxide N and/or potassium hydroxide are selected as a neutralizing base, corresponding to a pH range of said preparations of 6.0-8.0 when neutralized or partially neutralized, (III) the content of alkylated ammonium basis is less than 0.01 wt. %, (IV) 0.1-1.5 wt. % of one or more mono- and/or diesters of glycerol and/or propylene glycol and/or glycol, (V) 0.5-3 wt. % of one or several fatty alcohols selected from the group of branched and unbranched alkyl alcohols with 12-40 carbon atoms, (VI) 1-9 wt. % of a lipid phase consisting of (a) one or more lipids having a melting point of less than 30 °C, (b) one or several lipids having a melting point of more than 30 °C, (VII), the ratio of (a) to (b) ranging from 2:1 to 6:1, (VIII) whereby the lipids contain (a) 0-5 % silicon oil in relation to the overall weight of the preparations and ratio of the lipids (a) to the silicon oil (VIII) preferably ranges from 5:1 to 1:2.

WO 02/19973 A2 (57) Zusammenfassung: Kosmetische oder dermatologische Zubereitungen in Form einer O/W-Emulsion enthaltend (I) 1-5 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, einer oder mehrerer neutralisierten bzw. teilneutralisierten C<sub>14</sub>-C<sub>32</sub>-Fettsäuren, (II) wobei Natriumhydroxid und/oder Kaliumhydroxid als neutralisierende Base gewählt werden, neutralisiert bzw. teilneutralisiert einem pH-Bereich der Zubereitungen von 6,0-8,0 entsprechend, (III) wobei der Gehalt an alkylierten Ammoniumbasen geringer als 0,01 Gew.-% gewählt wird, (IV) 0,1 bis zu 1,5 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, eines oder mehrerer Mono- und/oder Diester von Glycerol und/oder von Propylenglycol und/oder von Glykol, (V) 0,5 bis zu 3% Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, einer oder mehrere Fettalkohole, gewählt aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylalkohole mit 12 bis 40 Kohlenstoffatomen, (VI) 1 bis zu 9 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, einer Lipidphase, zusammengesetzt aus (a) einem oder mehreren Lipiden mit einem Schmelzpunkt von unterhalb 30 °C, (b) einem oder mehreren Lipiden mit einem Schmelzpunkt von oberhalb 30 °C, (VII) wobei das Verhältnis aus (a) und (b) im Bereich von 2:1 bis 6:1 liegt, (VIII) wobei Lipide gemäss (a) 0-5 % Silikonöl umfassen, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, wobei das Verhältnis Lipide (a): Silikonöle (VIII) vorzugsweise im Bereich von 5:1 bis 1:2 liegt.

BEST AVAILABLE COPY

## Beschreibung

### Lipidarme kosmetische und dermatologische Zubereitungen in Form von O/W-Emulsionen mit einem Gehalt an Fettsäuren

Die vorliegende Erfindung betrifft kosmetische und dermatologische Emulsionen, insbesondere hautpflegende kosmetische und dermatologische Emulsionen. In einer vorteilhaften Ausführungsform betrifft die vorliegende Erfindung eine Anwendung, welche es erlaubt, die Stabilität von fettsäurehaltigen Zubereitungen, insbesondere Emulsionen, bevorzugt von O/W-Emulsionen, zu steigern.

Die Haut ist das größte Organ des Menschen. Unter ihren vielen Funktionen (beispielsweise zur Wärmeregulation und als Sinnesorgan) ist die Barrierefunktion, die das Austrocknen der Haut (und damit letztlich des gesamten Organismus) verhindert, die wohl wichtigste. Gleichzeitig wirkt die Haut als Schutzeinrichtung gegen das Eindringen und die Aufnahme von außen kommender Stoffe. Bewirkt wird diese Barrierefunktion durch die Epidermis, welche als äußerste Schicht die eigentliche Schutzhülle gegenüber der Umwelt bildet. Mit etwa einem Zehntel der Gesamtdicke ist sie gleichzeitig die dünnste Schicht der Haut.

Die Epidermis ist ein stratifiziertes Gewebe, in dem die äußere Schicht, die Hornschicht (Stratum comeum), den für die Barrierefunktion bedeutenden Teil darstellt. Das heute in der Fachwelt anerkannte Hautmodell von Elias (*P. M. Elias, Structure and Function of the Stratum Comeum Permeability Barrier, Drug Dev. Res. 13, 1988, 97-105*) beschreibt die Hornschicht als Zwei-Komponenten-System, ähnlich einer Ziegelsteinmauer (Ziegelstein-Mörtel-Modell). In diesem Modell entsprechen die Hornzellen (Korneozyten) den Ziegelsteinen, die komplex zusammengesetzte Lipidmembran in den Interzellularräumen entspricht dem Mörtel. Dieses System stellt im wesentlichen eine physikalische Barriere gegen hydrophile Substanzen dar, kann aber aufgrund seiner engen und mehrschichtigen Struktur gleichermaßen auch von lipophilen Substanzen nur schwer passiert werden.

Die vorliegende Erfindung betrifft in einer besonderen Ausführungsform kosmetische oder pharmazeutische Zubereitungen mit vermindertem Klebrigkeitsgefühl, Verfahren zu ihrer Herstellung sowie die Verwendung von Wirkstoffen zur Herabminderung des Klebrigkeitsgefühles kosmetischer Zubereitungen.

Außer ihrer Barrierewirkung gegen externe chemische und physikalische Einflüsse tragen die epidermalen Lipide auch zum Zusammenhalt der Hornschicht bei und haben Einfluß auf die Hautglätte. Im Gegensatz zu den Talgdrüsenlipiden, die keinen geschlossenen Film auf der Haut ausbilden, sind die epidermalen Lipide über die gesamte Hornschicht verteilt.

Das äußerst komplexe Zusammenwirken der feuchtigkeitsbindenden Substanzen und der Lipide der oberen Hautschichten ist für die Regulation der Hautfeuchte sehr wichtig. Daher enthalten Kosmetika in der Regel, neben ausgewogenen Lipidabmischungen und Wasser, wasserbindende Substanzen.

Neben der chemischen Zusammensetzung ist jedoch auch das physikalische Verhalten dieser Substanzen von Bedeutung. Daher ist die Entwicklung von sehr gut bioverträglichen Emulgatoren bzw. Tensiden wünschenswert. Damit formulierte Produkte unterstützen die flüssigkristalline Organisation der Interzellularlipide des Stratum Corneums und verbessern so die Barriereigenschaften der Hornschicht. Besonders vorteilhaft ist es, wenn deren Molekülbestandteile aus natürlicherweise in der Epidermis vorkommenden Substanzen bestehen.

Unter kosmetischer Hautpflege ist in erster Linie zu verstehen, daß die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umwelteinflüsse (z.B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z.B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) gestärkt oder wiederhergestellt wird.

Wird diese Funktion gestört, kann es zu verstärkter Resorption toxischer oder allergener Stoffe oder zum Befall von Mikroorganismen und als Folge zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

Ziel der Hautpflege ist es ferner, den durch tägliche Waschen verursachten Fett- und Wasserverlust der Haut auszugleichen. Dies ist gerade dann wichtig, wenn das natürliche Regenerationsvermögen nicht ausreicht. Außerdem sollen Hautpflegeprodukte vor Umwelteinflüssen, insbesondere vor Sonne und Wind, schützen und die Hautalterung verzögern.

Medizinische topische Zusammensetzungen enthalten in der Regel ein oder mehrere Medikamente in wirksamer Konzentration. Der Einfachheit halber wird zur sauberen Unterscheidung zwischen kosmetischer und medizinischer Anwendung und entsprechenden Produkten auf die gesetzlichen Bestimmungen der Bundesrepublik Deutschland verwiesen (z.B. Kosmetikverordnung, Lebensmittel- und Arzneimittelgesetz).

Übliche kosmetische Darreichungsformen sind Emulsionen. Darunter versteht man im allgemeinen ein heterogenes System aus zwei miteinander nicht oder nur begrenzt mischbaren Flüssigkeiten, die üblicherweise als Phasen bezeichnet werden. Die eine liegt dabei in Form von Tröpfchen vor (dispere oder innere Phase), während die andere Flüssigkeit eine kontinuierliche (kohärente oder äußere Phase) bildet. Seltener Darreichungsformen sind multiple Emulsionen, also solche, welche in den Tröpfchen der dispergierten (oder diskontinuierlichen) Phase ihrerseits Tröpfchen einer weiteren dispergierten Phase enthalten, z.B. W/O/W-Emulsionen und O/W/O-Emulsionen.

Neuere Erkenntnisse führten in letzter Zeit zu einem besseren Verständnis praxisrelevanter kosmetischer Emulsionen. Dabei geht man davon aus, daß die im Überschuß eingesetzten Emulgatorgemische lamellare flüssigkristalline Phasen bzw. kristalline Gelphasen ausbilden. In der Gelnetworktheorie werden Stabilität und physikochemische Eigenschaften solcher Emulsionen auf die Ausbildung von viskoelastischen Gelnetworken zurückgeführt.

Um die Metastabilität von Emulsionen gewährleisten zu können, sind in der Regel grenzflächenaktive Substanzen, also Emulgatoren, nötig. An sich ist die Verwendung der üblichen kosmetischen Emulgatoren völlig unbedenklich. Dennoch können Emulgatoren, wie letztlich jede chemische Substanz, im Einzelfalle allergische oder auf Überempfindlichkeit des Anwenders beruhende Reaktionen hervorrufen. So ist bekannt, daß bei manchen besonders empfindlichen Personen bestimmte Lichtdermatosen durch gewisse Emulgatoren und gleichzeitige Einwirkung von Sonnenlicht ausgelöst werden.

Es ist möglich, emulgatorfreie Zubereitungen herzustellen, welche beispielsweise in einer wäßrigen Phase dispergierte Öltröpfchen, ähnlich einer O/W-Emulsion, aufweisen. Voraussetzung dafür kann sein, daß die kontinuierliche wäßrige Phase ein die dispergierte Phase stabilisierendes Gelgerüst aufweist und andere Umstände mehr. Solche Systeme werden gelegentlich Hydrodispersionen oder Oleodispersionen genannt, je nachdem, welches die disperse und welches die kontinuierliche Phase darstellt.

Es ist für die kosmetische Galenik aber weder nötig noch möglich, auf Emulgatoren ganz zu verzichten, zumal eine gewisse Auswahl an besonders milden Emulgatoren existiert. Allerdings besteht ein Mangel des Standes der Technik an einer befriedigend großen Vielfalt solcher Emulgatoren, welche dann auch das Anwendungsspektrum entsprechend milder und hautverträglicher kosmetischer Zubereitungen deutlich verbreitern würde.

Physikochemisch stabile und sensorisch hochwertige Emulsionen mit niedrigem Lipidgehalt, sind schwierig zu formulieren und technisch herzustellen. Dieses gilt insbesondere für Stearat-Systeme, die als Neutralisationsmittel ausschließlich Natriumhydroxid oder aber Kaliumhydroxid enthalten.

Aufgabe war daher, all diesen den Nachteilen des Standes der Technik Abhilfe zu schaffen. Insbesondere sollten Produkte mit verringerter Klebrigkeit bzw. Schmierigkeit zur Verfügung gestellt werden. Produkte auf dem Gebiete der pflegenden Kosmetik, der dekorativen Kosmetik und der pharmakologischen Galenik sollten gleichermaßen von den geschilderten Nachteilen des Standes der Technik befreit werden.

Weiterhin war es eine Aufgabe der Erfindung, kosmetische Grundlagen für kosmetische Zubereitungen zu entwickeln, die sich durch gute Hautverträglichkeit auszeichnen.

Bekannte kosmetische Zubereitungen sind sogenannte „Stearatemulsionen“, also solchen, in welchen Stearinsäure und/oder Palmitinsäure bzw. Alkalisalze der Stearinsäure und/oder der Palmitinsäure als Emulgator wirksam sind. Diese Zubereitungen können vorteilhaft als O/W-Emulsionen vorliegen und zeichnen sich durch gutes Hautgefühl aus. Nachteilig ist jedoch, daß Fettsäuren in einem pH-Bereich von 3,5 - 8,0 zur Kristallisation neigen, wodurch das angenehme Hautgefühl sowie das äußere Erscheinungsbild einer entsprechenden Zubereitung stark beeinträchtigt werden.

Ferner war eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung, Produkte mit einer möglichst breiten Anwendungsvielfalt zur Verfügung zu stellen. Beispielsweise sollten Grundlagen für Zubereitungsformen wie Reinigungsemulsionen, Gesichts- und Körperpflegezubereitungen, aber auch ausgesprochen medizinisch-pharmazeutische Darreichungsformen geschaffen werden, zum Beispiel Zubereitungen gegen Akne und andere Hauterscheinungen.

Es hat sich überraschend gezeigt, und darin liegt die Lösung dieser Aufgaben, daß kosmetische oder dermatologische Zubereitungen in Form einer O/W-Emulsion enthaltend

- (I) 1 - 5 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, einer oder mehrerer neutralisierten bzw. teilneutralisierten  $C_{14}$ - $C_{32}$ -Fettsäuren
  - (II) wobei Natriumhydroxid und/oder Kaliumhydroxid als neutralisierende Base gewählt werden, neutralisiert bzw. teilneutralisiert einem pH-Bereich der Zubereitungen von 6,0 - 8,0 entsprechend,
  - (III) wobei der Gehalt an alkylierten Ammoniumbasen geringer als 0,01 Gew.-% gewählt wird
  - (IV) 0,1 bis zu 1,5 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, eines oder mehrerer Mono- und/oder Diester von Glycerol und/oder von Propylenglycol und/oder von Glykol,
  - (V) 0,5 bis zu 3 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, einer oder mehrere Fettalkohole, gewählt aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylalkohole mit 12 bis 40 Kohlenstoffatomen,
  - (VI) 1 bis zu 9 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, einer Lipidphase, zusammengesetzt aus
    - (a) einem oder mehreren Lipiden mit einem Schmelzpunkt von unterhalb 30 °C
    - (b) einem oder mehreren Lipiden mit einem Schmelzpunkt von oberhalb 30 °C
  - (VII) wobei das Verhältnis aus (a) und (b) im Bereich von 2:1 bis 6:1 liegt.
  - (VIII) wobei Lipide gemäß (a) 0 - 5% Silikonöl umfassen, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen
  - (IX) wobei das Verhältnis Lipide (a) : Silikonöle (VIII) vorzugsweise im Bereich von 5 : 1 bis 1 : 2 liegt,
- den Nachteilen des Standes der Technik abhelfen.

Es war für den Fachmann daher nicht vorauszusehen gewesen, daß die erfindungsgemäßen Zubereitungen

- besser als feuchtigkeitsspendende Zubereitungen wirken,
- besser die Hautglättung fördern,
- sich durch besser Pflegewirkung auszeichnen,
- besser als Vehikel für kosmetische und medizinisch-dermatologische Wirkstoffe dienen,
- höhere Stabilität gegenüber physikalischer Zersetzung, insbesondere Phasentrennung aufweisen,
- höhere Stabilität gegenüber der Kristallisation der eingesetzten Fettsäuren aufweisen,
- sich durch bessere Bioverträglichkeit auszeichnen würden,
- sich durch besseres Hautgefühl und durch höhere kosmetische Eleganz auszeichnen würden

als die Zubereitungen des Standes der Technik. Erfindungsgemäß lassen sich sehr gute physikochemische Stabilitäten erzielen, ohne daß es nach einer längeren Lagerzeit insbesondere auch bei hohen Temperaturen zu Instabilitäten kommt (z.B. 6 Monate bei 40 °C, 2 Monate bei 50 °C, 1 Woche bei 70 °C). Hierdurch ist es möglich, Rezepturen mit überdurchschnittlich guter Hautpflege und einer herausragenden, ausgewogenen Sensorik herzustellen. Diese zeichnet sich insbesondere durch ein gutes Einzugsvermögen und durch einen auffällig geringen Rückstand aus, obwohl das Produkt während des Verteilens eine geschmeidige Reichhaltigkeit vermittelt.

Die erfindungsgemäßen Zubereitungen sind sowohl fließfähig als auch crèmeartig formulierbar, besitzen sehr gute kosmetische Eigenschaften, insbesondere was die Klebrigkeit betrifft, und weisen eine sehr gute Hautverträglichkeit sowie Hautpflegeleistung auf.

Bevorzugte Fettsäuren sind Stearinsäure und/oder Palmitinsäure (Stearin).

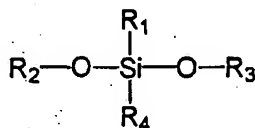
Vorteilhafte Ausführungsformen der vorliegenden Erfindung betreffen kosmetische und dermatologische Zubereitungen, enthaltend

- (IV) 0,1 bis zu 1,5 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, gewählt aus der Gruppe Glycerylmonostearat, Glyceryldistearat, Propylenglycolmonostearat, Glycerylisostearat, Glyceryllanolat, Glycerylmyristat, Glyceryllaurat, Glyceryloleat, Glycerylstearatcitrat,

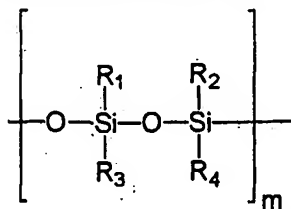
Im Rahmen der vorliegenden Offenbarung wird als Oberbegriff für Fette, Öle, Wachse und dergleichen gelegentlich der Ausdruck „Lipide“ verwendet, wie dem Fachmanne durchaus geläufig ist. Auch werden die Begriffe „Ölphase“ und „Lipidphase“ synonym angewandt.

Vorteilhaft werden der oder die Fettalkohole gewählt aus der Gruppe der einwertigen Alkohole mit 12 – 30 Kohlenstoffatomen in geraden Ketten, Dodecanol (Laurylalkohol,  $C_{12}H_{25}OH$ ), Tetradecanol (Myristylalkohol,  $C_{14}H_{29}OH$ ), Hexadecanol (Cetylalkohol,  $C_{16}H_{33}OH$ ), Octadecanol (Stearylalkohol,  $C_{18}H_{37}OH$ ), Oleylalkohol ( $C_{18}H_{35}OH$ ), Eikosylalkohol ( $C_{20}H_{39}OH$ ), Dokosanylalkohol ( $C_{22}H_{43}OH$ ), Tetrakosanylalkohol (Carnaubylalkohol,  $C_{24}H_{49}OH$ ), Hexakosanylalkohol (Cerylalkohol,  $C_{26}H_{53}OH$ ), Triakontylalkohol (Myricylalkohol,  $C_{30}H_{61}OH$ ).

Es wird bevorzugt, die den Anteil der Siliconöle der erfindungsgemäßen Zubereitungen aus der Gruppe der cyclischen und/oder linearen Silicone zu wählen, welche im Rahmen der vorliegenden Offenbarung auch als „Siliconöle“ bezeichnet werden. Solche Silicone oder Siliconöle können als Monomere vorliegen, welche in der Regel durch Strukturelemente charakterisiert sind, wie folgt:



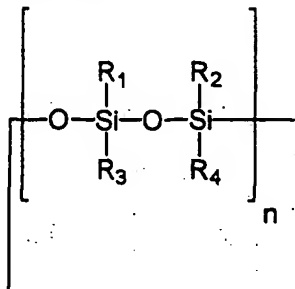
Als erfindungsgemäß vorteilhaft einzusetzenden linearen Silicone mit mehreren Siloxyleinheiten werden im allgemeinen durch Strukturelemente charakterisiert wie folgt:



wobei die Siliciumatome mit gleichen oder unterschiedlichen Alkylresten und/oder Arylresten substituiert werden können, welche hier verallgemeinend durch die Reste  $R_1 - R_4$  dargestellt sind (will sagen, daß die Anzahl der unterschiedlichen Reste nicht notwendig auf bis zu 4 beschränkt ist).  $m$  kann dabei Werte von 2 - 200.000 annehmen.



Erfindungsgemäß vorteilhaft einzusetzende cyclische Silicone werden im allgemeinen durch Strukturelemente charakterisiert, wie folgt



wobei die Siliciumatome mit gleichen oder unterschiedlichen Alkylresten und/oder Arylresten substituiert werden können, welche hier verallgemeinernd durch die Reste  $R_1 - R_4$  dargestellt sind (will sagen, daß die Anzahl der unterschiedlichen Reste nicht notwendig auf bis zu 4 beschränkt ist).  $n$  kann dabei Werte von  $3/2$  bis 20 annehmen. Gebrochene Werte für  $n$  berücksichtigen, daß ungeradzahlige Anzahlen von Siloxylgruppen im Cyclus vorhanden sein können.

Vorteilhaft wird Phenyltrimethicon als Siliconöl gewählt. Auch andere Silikonöle, beispielsweise Dimethicon, Phenyldimethicon, Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan), Cetyldimethicon, Behenoxydimethicon sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

Vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, sowie solche aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

Weitere Ölkomponenten können beispielsweise gewählt werden aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen sowie aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyloleat, n-Butylstearat, n-Hexyllaurat, n-Decyloleat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononylisononanoat, 2-

Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyloleat, Oleylerucat, Erucyloleat, Erucylerucat sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, wie z.B. Jojobaöl.

Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole. Es ist insbesondere vorteilhaft, wenn die Ölphase der erfindungsgemäßen W/O-Emulsionen einen Gehalt an C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat oder aber Cetylstearylethylhexanoat aufweist oder vollständig aus diesem besteht.

Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

Vorteilhafte Ölkomponenten sind ferner beispielsweise solche, welche gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, insbesondere Vaseline (Petrolatum), Paraffinöl, Squalan und Squalen, Polyolefine und hydrogenierte Polyisobutene. Unter den Polyolefinen sind Polydecene die bevorzugten Substanzen. Die nachfolgende Tabelle 1 führt Lipide auf, die als Einzelsubstanzen oder auch im Gemisch untereinander erfindungsgemäß vorteilhaft sind. Die betreffenden Grenzflächenspannungen gegen Wasser sind in der letzten Spalte angegeben. Es ist jedoch auch vorteilhaft, Gemische aus höher- und niederpolareren und dergleichen zu verwenden.

Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z.B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

Erfindungsgemäß vorteilhaft zu verwendende Lipide mit einem Schmelzpunkt von oberhalb 30 °C können vorteilhaft aus der Gruppe der pflanzlichen Wachse, tierischen Wachse, Mineralwaxse und petrochemischen Wachse gewählt werden. Erfindungsgemäß günstig sind beispielsweise Candelillawachs, Carnaubawachs, Japanwachs, Espartograswachs, Korkwachs, Guarumawachs, Reiskeimölwachs, Zuckerrohrwachs, Beerenwachs, Ouricurywachs, Montanwachs, Jöjobawachs, Shea Butter, Bienenwachs, Schellackwachs, Walrat, Lanolin (Wollwachs), Bürzelfett, Ceresin, Ozokerit (Erdwachs), Paraffinwaxse und Mikrowachse, sofern die im Hauptanspruch geforderten Bedingungen eingehalten werden.

Weitere vorteilhafte Lipide mit einem Schmelzpunkt von oberhalb 30 °C sind chemisch modifizierte Wachse und synthetische Wachse, wie beispielsweise die unter den Handelsbezeichnungen Syncrowax HRC (Glyceryltribehenat), Syncrowax HGLC (C<sub>16-36</sub>-Fettsäuretriglycerid) und Syncrowax AW 1C (C<sub>18-36</sub>-Fettsäure) bei der CRODA GmbH erhältlichen sowie Montanesterwaxse, Sasolwaxse, hydrierte Jöjobawachse, synthetische oder modifizierte Bienenwaxse (z. B. Dimethicon Copolyol Bienenwachs und/oder C<sub>30-50</sub>-Alkyl Bienenwachs), Polyalkylenwaxse, Polyethylenglykolwaxse, aber auch chemisch modifizierte Fette, wie z. B. hydrierte Pflanzenöle (beispielsweise hydriertes Ricinusöl und/oder hydrierte Cocosfettglyceride), Triglyceride, wie beispielsweise Trihydroxystearin, Fettsäuren, Fettsäureester und Glykolester, wie beispielsweise C<sub>20-40</sub>-Alkylstearat, C<sub>20-40</sub>-Alkylhydroxystearoylstearat und/oder Glykolmontanat. Weiter vorteilhaft sind auch bestimmte Organosiliciumverbindungen, die ähnliche physikalische Eigenschaften aufweisen wie die genannten Fett- und/oder Wachskomponenten, wie beispielsweise Stearoxytrimethylsilan sofern die im Hauptanspruch geforderten Bedingungen eingehalten werden.

Erfindungsgemäß können die Lipide mit einem Schmelzpunkt von oberhalb 30 °C sowohl einzeln als auch im Gemisch vorliegen.

Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen.

Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Isoleicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat, Cetylstearylhexanoat, Isopropylmyristat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether sofern die im Hauptanspruch geforderten Bedingungen eingehalten werden.

Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkybenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Cetearyl Ethylhexanoate, Mischungen aus Cetylstearylhexanoat und Isopropylmyristat sowie Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkybenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat sofern die im Hauptanspruch geforderten Bedingungen eingehalten werden.

Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Cycloparaffin, Squalan, Squalen, hydriertes Polyisobuten bzw. Polydecen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, sofern die im Hauptanspruch geforderten Bedingungen eingehalten werden.

Als Grundbestandteile der erfindungsgemäßen Zubereitungen können verwendet werden:

- Wasser oder wäßrige Lösungen
- wäßrige ethanolische Lösungen
- natürliche Öle und/oder chemisch modifizierte natürliche Öle und/oder synthetische Öle;
- Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z.B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
- Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte.

Insbesondere werden Gemische der vorstehend genannten Lösungsmittel verwendet.

Die wäßrige Phase der erfindungsgemäßen Zubereitungen enthält gegebenenfalls vorteilhaft Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte, ferner Alkohole niedriger C-Zahl, z.B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin sowie insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliciumdioxid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren Derivate, z.B. Hy-

aluronsäure, Xanthangummi, Hydroxypropylmethylcellulose, besonders vorteilhaft aus der Gruppe der Polyacrylate, bevorzugt ein Polyacrylat aus der Gruppe der sogenannten Carbopole, beispielsweise Carbopole der Typen 980, 981, 1382, 2984, 5984, jeweils einzeln oder in Kombination.

Erfindungsgemäße Emulsionen im Sinne der vorliegenden Erfindung, z.B. in Form einer Hautschutzcrème, einer Hautlotion, einer kosmetischen Milch, beispielsweise in Form einer Sonnenschutzcreme oder einer Sonnenschutzmilch, sind vorteilhaft und enthalten z.B. Fette, Öle, Wachse und/oder andere Fettkörper, sowie Wasser und einen oder mehrere Emulgatoren, wie sie üblicherweise für einen solchen Typ der Formulierung verwendet werden.

Es ist dem Fachmanne natürlich bekannt, daß anspruchsvolle kosmetische Zusammensetzungen zumeist nicht ohne die üblichen Hilfs- und Zusatzstoffe denkbar sind. Darunter zählen beispielsweise Konsistenzgeber, Füllstoffe, Parfum, Farbstoffe, Emulgatoren, zusätzliche Wirkstoffe wie Vitamine oder Proteine, Lichtschutzmittel, Stabilisatoren, Insektenrepellentien, Alkohol, Wasser, Salze, antimikrobiell, proteolytisch oder keratolytisch wirksame Substanzen usw.

Mutatis mutandis gelten entsprechende Anforderungen an die Formulierung medizinischer Zubereitungen.

Medizinische topische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung enthalten in der Regel ein oder mehrere Medikamente in wirksamer Konzentration. Der Einfachheit halber wird zur sauberen Unterscheidung zwischen kosmetischer und medizinischer Anwendung und entsprechenden Produkten auf die gesetzlichen Bestimmungen der Bundesrepublik Deutschland verwiesen (z.B. Kosmetikverordnung, Lebensmittel- und Arzneimittelgesetz).

Entsprechend können kosmetische oder topische dermatologische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, je nach ihrem Aufbau, beispielsweise verwendet werden als Hautschutzcrème, Reinigungsmilch, Sonnenschutzlotion, Nährcrème, Tages- oder Nachtcrème usw. Es ist gegebenenfalls möglich und vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen als Grundlage für pharmazeutische Formulierungen zu verwenden.

Es ist ebenfalls von Vorteil, von den erfindungsgemäßen Eigenschaften in Form von dekorativen Kosmetika (Make-Up-Formulierungen) Gebrauch zu machen.

Günstig sind auch solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen. Vorzugsweise enthalten diese neben dem erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff zusätzlich mindestens eine UVA-Filtersubstanz und/oder mindestens eine UVB-Filtersubstanz und/oder mindestens ein anorganisches Pigment.

Es ist aber auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindungen, solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlicher Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden beispielsweise in Tagescrèmes gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet.

Vorteilhaft können erfindungsgemäße Zubereitungen Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z.B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1 bis 6 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Die UVB-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Als öllösliche Substanzen sind z.B. zu nennen:

- 3-Benzylidencampher und dessen Derivate, z.B. 3-(4-Methylbenzyliden)campher,
- 4-Aminobenzoësäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoësäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoësäureamylester,
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester,
- Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Salicylsäurehomomenthylester,
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;
- 2,4,6-Triänilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin

Als wasserlösliche Substanzen sind vorteilhaft:

- 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure und deren Salze, z.B. Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salze,
- Sulfonsäure-Derivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure und ihre Salze;
- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z.B. 4-(2-Oxo-3-benzylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-benzylidenmethyl)sulfonsäure und ihre Salze.

Die Liste der genannten UVB-Filter, die erfindungsgemäß Verwendung finden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

Es kann auch von Vorteil sein, in erfindungsgemäßen Zubereitungen UVA-Filter einzusetzen, die üblicherweise in kosmetischen und/oder dermatologischen Zubereitungen enthalten sind. Bei solchen Filtersubstanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-tert-Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion. Auch Zubereitungen, die diese Kombinationen enthalten, sind Gegenstand der Erfindung. Es können die gleichen Mengen an UVA-Filtersubstanzen verwendet werden, welche für UVB-Filtersubstanzen genannt wurden.

Kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können auch anorganische Pigmente enthalten, die üblicherweise in der Kosmetik zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen verwendet werden. Dabei handelt es sich um Oxide des Titans, Zinks, Eisens, Zirkoniums, Siliciums, Mangans, Aluminiums, Cers und Mischungen davon, sowie Abwandlungen, bei denen die Oxide die aktiven Agentien sind. Besonders bevorzugt handelt es sich um Pigmente auf der Basis von Titandioxid. Es können die für die vorstehenden Kombinationen genannten Mengen verwendet werden.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen können kosmetische Wirk-, Hilfs- und/oder Zusatzstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z.B. Antioxidationsmittel, Konservierungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die färbende

Wirkung haben, Verdickungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Emulgatoren, weichmachende, anfeuchtende und/oder feuchthaltende Substanzen, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel oder Silikonderivate.

Es ist vorteilhaft, den Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung weitere antiirritative oder antientzündliche Wirkstoffe zuzugeben, insbesondere Batylalkohol ( $\alpha$ -Octadecylglycerylether), Selachylalkohol ( $\alpha$ -9-Octadecenylglycerylether), Chimylalkohol ( $\alpha$ -Hexadecylglycerylether), Bisabolol und/oder Panthenol.

Es ist ebenfalls vorteilhaft, den Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung übliche Antioxidantien zuzufügen. Erfindungsgemäß können als günstige Antioxidantien alle für kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen geeigneten oder gebräuchlichen Antioxidantien verwendet werden.

Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z.B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z.B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z.B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z.B.  $\alpha$ -Carotin,  $\beta$ -Carotin,  $\psi$ -Lycopin) und deren Derivate, Chlorogensäure und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z.B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z.B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-,  $\gamma$ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z.B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z.B. pmol bis  $\mu$ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z.B.  $\alpha$ -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin),  $\alpha$ -Hydroxysäuren (z.B. Citronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z.B.  $\gamma$ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Furfurylidensorbitol und dessen Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z.B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbyl-



phosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z.B. Vitamin-E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin-A-palmitat) sowie Koniferylbenzoat des Benzoeharzes, Rutinsäure und deren Derivate,  $\alpha$ -Glycosylrutin, Ferulasäure, Furfurylidenglucitol, Camosin, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretssäure, Trihydroxybutyrophenon, Hamsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z.B. ZnO, ZnSO<sub>4</sub>) Selen und dessen Derivate (z.B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z.B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 - 20 Gew.-%, insbesondere 1 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Sofem Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, die erfindungsgemäßen Zubereitungen als Grundlage für kosmetische oder dermatologische Zubereitungen gegen Hyperpigmentierung der Haut (z.B. als sogenannte Skin-Whitening-Produkte) zu verwenden. Es können diesen Zubereitungen die üblichen Wirkstoffe für diese Zwecke einverleibt werden, z.B. auf der Grundlage von Hydrochinon, Kojisäure, Ascorbinsäure und Azelainsäure sowie deren Derivaten.

Zubereitungen gemäß der vorliegenden Erfindung können auch Verwendung als Grundlage für kosmetische oder dermatologische Desodorantien bzw. Antitranspirantien finden. Alle für Desodorantien bzw. Antitranspirantien gängigen Wirkstoffe können vorteilhaft genutzt werden, beispielsweise Geruchsüberdecker wie die gängigen Parfümbestandteile, Geruchsabsorber, beispielsweise die in der Patentoffenlegungsschrift DE-P 40 09 347 beschriebenen Schichtsilikate, von diesen insbesondere Montmorillonit, Kaolinit, Illit, Beidellit, Nontronit, Saponit, Hectorit, Bentonit, Smectit, ferner beispielsweise Zinksalze der Ricinolsäure.

Keimhemmende Mittel sind ebenfalls geeignet, in die erfindungsgemäßen Zubereitungen eingearbeitet zu werden. Vorteilhafte Substanzen sind zum Beispiel 2,4,4'-Trichlor-2'-hydroxydiphenylether (Irgasan), 1,6-Di-(4-chlorphenylbiguanido)-hexan (Chlorhexidin), 3,4,4'-Trichlorcarbanilid, quaternäre Ammoniumverbindungen, Nelkenöl, Minzöl, Thymianöl, Triethylcitrat, Farnesol (3,7,11-Trimethyl-2,6,10-dodecatrien-1-ol) sowie die in den Patentoffenlegungsschriften DE-37 40 186, DE-39 38 140, DE-42 04 321, DE-42 29 707, DE-43 09 372, DE-44 11 664, DE-195 41 967, DE-195 43 695, DE-195 43 696, DE-195 47 160, DE-196 02 108, DE-196 02 110, DE-196 02 111, DE-196 31 003, DE-196 31 004 und DE-196 34 019 und den Patentschriften DE-42 29 737, DE-42 37 081, DE-43 24 219, DE-44 29 467, DE-44 23 410 und DE-195 16 705 beschriebenen Wirkstoffe bzw. Wirkstoffkombinationen. Auch Natriumhydrogencarbonat ist vorteilhaft zu verwenden.

Die Menge solcher Wirkstoffe (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen gemäß der Erfindung beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 - 20 Gew.-%, insbesondere 1 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Die Wasserphase der kosmetischen Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung kann auch Gelcharakter aufweisen, die neben einem wirksamen Gehalt am erfindungsgemäß eingesetzten Substanzen und dafür üblicherweise verwendeten Lösungsmitteln, bevorzugt Wasser, noch weitere organische Verdickungsmittel, z.B. Gummiarabikum, Xanthangummi, Natriumalginat, Stärke und Stärkederivate (z.B. Distärkephosphat), Cellulose, Cellulose-Derivate, vorzugsweise Methylcellulose, Hydroxymethylcellulose, Hydroxyethylcellulose, Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose oder anorganische Verdickungsmittel, z. B. Aluminiumsilikate wie beispielsweise organisch modifizierte oder auch unmodifizierte Hectorite, Bentonite, oder dergleichen, oder ein Gemisch aus Polyethylenglykol und Polyethylenglykolstearat oder -distearat, enthalten. Das Verdickungsmittel ist in dem Gel z.B. in einer Menge zwischen 0,1 und 30 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,5 und 15 Gew.-%, enthalten.

Ferner kann es von Vorteil sein, Zubereitungen gemäß der Erfindung grenz- bzw. oberflächenaktive Agentien zuzufügen, beispielsweise kationische Emulgatoren wie insbesondere quaternäre Tenside.

Quatemäre Tenside enthalten mindestens ein N-Atom, das mit 4 Alkyl- oder Arylgruppen kovalent verbunden ist. Dies führt, unabhängig vom pH Wert, zu einer positiven Ladung. Vorteilhaft sind, Alkylbetain, Alkylamidopropylbetain und Alkyl-amidopropylhydroxysulfain. Die erfindungsgemäß verwendeten kationischen Tenside können ferner bevorzugt gewählt werden aus der Gruppe der quatemären Ammoniumverbindungen, insbesondere Benzyltrialkylammoniumchloride oder -bromide, wie beispielsweise Benzoldimethylstearylammoniumchlorid, ferner Alkyltrialkylammoniumsalze, beispielsweise beispielsweise Cetyltrimethylammoniumchlorid oder -bromid, Alkyldimethylhydroxyethylammoniumchloride oder -bromide, Dialkyldimethylammoniumchloride oder -bromide, Alkylamidethyltrimethylammoniumethersulfate, Alkylpyridiniumsalze, beispielsweise Lauryl- oder Cetylpyrimidiniumchlorid, Imidazolinderivate und Verbindungen mit kationischem Charakter wie Aminoxide, beispielsweise Alkyldimethylaminoxide oder Alkylaminoethylaminoxide. Vorteilhaft sind insbesondere Cetyltrimethylammoniumsalze zu verwenden.

Vorteilhaft ist auch, kationische Polymere (z.B. Jaguar® C 162 [Hydroxypropyl Guar Hydroxypropyltrimonium Chloride] bzw. modifizierten Magnesiumaluminiumsilikaten (z.B. Quaternium-18-Hectorit, welches z. B. unter der Handelsbezeichnung Bentone® 38 bei der Firma Rheox erhältlich ist, oder Stearalkonium Hectorit, welches z. B. unter der Handelsbezeichnung Softisan® Gel bei der Hüls AG erhältlich ist), einzusetzen.

Erfindungsgemäße Zubereitungen können vorteilhaft auch Ölverdickungsmittel enthalten, um die taktilen Eigenschaften der Emulsion und die Stiftkonsistenz zu verbessern. Vorteilhafte Ölverdickungsmittel im Sinne der vorliegenden Erfindung sind beispielsweise weitere Feststoffe, wie z. B. hydrophobe Siliciumoxide des Typs Aerosil®, welche von der Degussa AG erhältlich sind. Vorteilhafte Aerosil®-Typen sind beispielsweise Aerosil® OX50, Aerosil® 130, Aerosil® 150, Aerosil® 200, Aerosil® 300, Aerosil® 380, Aerosil® MOX 80, Aerosil® MOX 170, Aerosil® COK 84, Aerosil® R 202, Aerosil® R 805, Aerosil® R 812, Aerosil® R 972, Aerosil® R 974 und/oder Aerosil® R976.

Ferner sind auch sogenannte Metallseifen (d. h. die Salze höherer Fettsäuren mit Ausnahme der Alkalisalze) vorteilhafte Ölverdickungsmittel im Sinne der vorliegenden Erfindung, wie beispielsweise Aluminium-Stearat, Zink-Stearat und/oder Magnesium-Stearat.

Ebenfalls vorteilhaft ist, Zubereitungen gemäß der Erfindung amphotere bzw. zwitterionische Tenside (z.B. Cocoamidopropylbetain) und Moisturizer (z.B. Betain) zuzusetzen. Vorteilhaft zu verwendende amphotere Tenside sind beispielsweise Acyl-/dialkylethylendiamin, beispielsweise Natriumacylamphoacetat, Dinatriumacylamphodipropionat, Dinatriumalkylamphodiaceat, Natriumacylamphohydroxypropylsulfonat, Dinatriumacylamphodiaceat und Natriumacylamphopropionat, N-Alkylaminosäuren, beispielsweise Aminopropylalkylglutamid, Alkylaminopropionsäure, Natriumalkylimidodipropionat und Lauroamphocarboxyglycinat.

Die Menge der ober- bzw. grenzflächenaktiven Substanzen (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen gemäß der Erfindung beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 - 20 Gew.-%, insbesondere 1 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Erfindungsgemäße Zubereitungen können auch Wirkstoffe (eine oder mehrere Verbindungen) enthalten, welche gewählt werden aus der Gruppe: Acetylsalicylsäure, Atropin, Azulen, Hydrocortison und dessen Derivaten, z.B. Hydrocortison-17-valerat, Vitamine, z.B. Ascorbinsäure und deren Derivate, Vitamine der B- und D-Reihe, sehr günstig das Vitamin B<sub>1</sub>, das Vitamin B<sub>12</sub> das Vitamin D<sub>1</sub>, aber auch Bisabolol, ungesättigte Fettsäuren, namentlich die essentiellen Fettsäuren (oft auch Vitamin F genannt), insbesondere die  $\gamma$ -Linolensäure, Ölsäure, Eicosapentaensäure, Docosahexaensäure und deren Derivate, Chloramphenicol, Coffein, Prostaglandine, Thymol, Campher, Extrakte oder andere Produkte pflanzlicher und tierischer Herkunft, z.B. Nachtkerzenöl, Borretschöl oder Johannisbeerkernöl, Fischöle, Lebertran aber auch Ceramide und ceramidähnliche Verbindungen und so weiter. Vorteilhaft ist es auch, die Wirkstoffe aus der Gruppe der rückfettenden Substanzen zu wählen, beispielsweise Purcellinöl, Eucerit® und Neocerit®.

Die Menge solcher Wirkstoffe (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen gemäß der Erfindung beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 - 20 Gew.-%, insbesondere 1 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen.

**Beispiel 1 (O/W-Creme):**

	Gew.-%
Stearinsäure	3,00
Cetylalkohol	2,50
Glycerylstearat	1,00
Octyldodecanol	3,00
Cyclomethicon	1,00
Myristylmyristat	2,00
Glycerin	5,00
Carbomer	0,10
Natriumhydroxid	q.s.
Konservierung	q.s.
Parfum	q.s.
Wasser, demineralisiert	ad 100,00
pH-Wert eingestellt auf 6,0- 8,0	

**Beispiel 2 (O/W-Lotion):**

	Gew.-%
Stearinsäure	2,00
Myristylalcohol	0,50
Cetylstearylalcohol	0,50
Glykolstearat	0,25
Glycerylstearat	0,75
Cetylpalmitat	0,70
Octylpalmitat	4,20
Glycerin	3,00
Carbomer	0,10
Magnesium-Aluminium-Silikat	0,20
Kaliumhydroxid	q.s.
Konservierung	q.s.
Parfum	q.s.
Wasser, demineralisiert	ad 100,00
pH-Wert eingestellt auf 6,5-7,5	

**Beispiel 3 (O/W-Lotion):**

	Gew.-%
Stearinsäure	2,00
Cetylstearylalkohol	1,50
Glycerylstearat	1,00
Caprylsäure-/Caprinsäuretriglyceride	1,00
Cetylstearylethylhexanoat	1,00
Dicapryylether	2,00
Hydriertes Cocoglycerid	2,00
Dimethicon	2,00
Xanthangummi	0,10
Magnesiumsilikat	0,10
Glycerin	3,00
Parfüm, Konservierungsmittel,	q.s.
Natriumhydroxid	q.s.
Farbstoffe usw.	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert eingestellt auf 7,0 - 8,0	

**Beispiel 4 (O/W-Emulsions-Make-up):**

	Gew.-%
Stearinsäure	1,00
Cetylalkohol	2,00
Glykolstearat	0,50
Glycerylstearat	0,25
Cetearylisononanoat	2,00
Isopropylpalmitat	1,00
Dimethicon	0,60
Cetylpalmitat	0,70
Glycerin	3,00
Carbomer	0,15
Glimmer	1,00
Magnesiumsilikat	1,00
Eisenoxid	1,00
Titandioxid	2,50
Talkum	5,00
Vitamin A Palmitat	0,10
Natriumhydroxid	q.s.
Konservierung	q.s.
Parfum	q.s.
Wasser, demineralisiert	ad 100,00
pH-Wert eingestellt auf 6,0 – 8,0	

**Beispiel 5 (O/W-Creme):**

	Gew.-%
Stearinsäure	4,00
Cetylalkohol	2,50
Glyceryldistearat	1,00
Octyldodecanol	3,00
Hydriertes Kokosfettsäureglycerid	2,00
Cyclomethicon	2,00
Vitamin E Acetat	1,00
Xanthangummi	0,10
Carbomer	0,10
Retinylpalmitat	0,20
Glycerin	3,00
BHT	0,02
Na <sub>2</sub> H <sub>2</sub> EDTA	0,10
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe	q.s.
Kaliumhydroxid	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert eingestellt auf 7,0 - 8,0	



**Beispiel 6 (O/W-Lotion):**

	Gew.-%
Stearinsäure	2,00
Cetylstearylalkohol	2,00
Glykolstearat	0,30
Glycerylstearat	0,30
Caprylsäure-/Caprinsäuretriglycerid	1,00
Cetylstearylethylhexanoat	1,00
Dimethicon	4,00
Myristylmyristat	1,00
Vitamin E Acetat	2,00
Natriumcarbomer	0,10
Glycerin	3,00
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe usw.	q.s.
Natriumhydroxid	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert eingestellt auf 6,0 - 7,5	

**Beispiel 7 (Sonnenschutz-Creme):**

	Gew.-%
Stearinsäure	3,50
Cetylalkohol	1,50
Myristylalkohol	1,00
Glycerylstearate	1,00
Octyldodecanol	1,00
C <sub>12-15</sub> -Alkylbenzoate	2,00
Paraffinöl	0,50
Dimethicon	1,00
Cetylpalmitat	0,80
Xanthangummi	0,10
Natriumcarbomer	0,10
Glycerin	3,00
Octylmethoxycinnamat	4,00
Benzophenon-3	3,00
Octylsalicylat	3,00
BHT	0,02
Na <sub>2</sub> H <sub>2</sub> EDTA	0,10
Parfüm, Konservierungsmittel, Farbstoffe, usw.	q.s.
Kaliumhydroxid	q.s.
Wasser	ad 100,00
pH-Wert eingestellt auf 6,5 - 8,0	

**Patentansprüche:**

1. Kosmetische oder dermatologische Zubereitungen in Form einer O/W-Emulsion enthaltend

- (I) 1 - 5 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, einer oder mehrerer neutralisierten bzw. teilneutralisierten C<sub>14</sub>-C<sub>32</sub>-Fettsäuren
- (II) wobei Natriumhydroxid und/oder Kaliumhydroxid als neutralisierende Base gewählt werden, neutralisiert bzw. teilneutralisiert einem pH-Bereich der Zubereitungen von 6,0 - 8,0 entsprechend,
- (III) wobei der Gehalt an alkylierten Ammoniumbasen geringer als 0,01 Gew.-% gewählt wird
- (IV) 0,1 bis zu 1,5 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, eines oder mehrerer Mono- und/oder Diester von Glycerol und/oder von Propylenglycol und/oder von Glykol,
- (V) 0,5 bis zu 3 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, einer oder mehrere Fettalkohole, gewählt aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylalkohole mit 12 bis 40 Kohlenstoffatomen,
- (VI) 1 bis zu 9 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, einer Lipidphase, zusammengesetzt aus
  - (a) einem oder mehreren Lipiden mit einem Schmelzpunkt von unterhalb 30 °C
  - (b) einem oder mehreren Lipiden mit einem Schmelzpunkt von oberhalb 30 °C
- (VII) wobei das Verhältnis aus (a) und (b) im Bereich von 2:1 bis 6:1 liegt.
- (VIII) wobei Lipide gemäß (a) 0 - 5% Silikonöl umfassen, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.
- (IX) wobei das Verhältnis Lipide (a) : Silikonöle (VIII) vorzugsweise im Bereich von 5:1 bis 1 : 2 liegt.

2. Zubereitungen nach Anspruch 1, enthaltend

- (IV) 0,1 bis zu 1,5 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, gewählt aus der Gruppe Glycerylmonostearat, Glyceryldistearat, Propylenglycolmonostearat, Glycerylisostearat, Glyceryllanolat, Glycerylmyristat, Glyceryllaurat, Glyceryloleat, Glycerylstearatcitrat.

3. Zubereitungen nach Anspruch 1, enthaltend einen oder mehrere Fettalkohole gewählt aus der Gruppe der einwertigen Alkohole mit 12 – 30 Kohlenstoffatomen in geraden Ketten, Dodecanol (Laurylalkohol,  $C_{12}H_{25}OH$ ), Tetradecanol (Myristylalkohol,  $C_{14}H_{29}OH$ ), Hexadecanol (Cetylalkohol,  $C_{16}H_{33}OH$ ), Octadecanol (Stearylalkohol,  $C_{18}H_{37}OH$ ), Oleylalkohol ( $C_{18}H_{35}OH$ ), Eikosylalkohol ( $C_{20}H_{39}OH$ ), Dokosanylalkohol ( $C_{22}H_{43}OH$ ), Tetrakosanylalkohol (Camaubylalkohol,  $C_{24}H_{49}OH$ ), Hexakosanylalkohol (Cerylalkohol,  $C_{26}H_{53}OH$ ), Triakontylalkohol (Myrcylalkohol,  $C_{30}H_{61}OH$ ).

4. Zubereitungen nach Anspruch 1, in denen die Fettsäuren Stearinsäure und/oder Palmitinsäure (Stearin) sind.

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☒ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☐ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER: \_\_\_\_\_**

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**